

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2004-26816

(P2004-26816A)

(43) 公開日 平成16年1月29日(2004.1.29)

(51) Int.C1.⁷

A61K 7/16

F 1

A 61 K 7/16

テーマコード(参考)

4 C 0 8 3

審査請求 未請求 請求項の数 7 O L (全 8 頁)

(21) 出願番号 特願2003-128936 (P2003-128936)
(22) 出願日 平成15年5月7日 (2003.5.7)
(31) 優先権主張番号 特願2002-132323 (P2002-132323)
(32) 優先日 平成14年5月8日 (2002.5.8)
(33) 優先権主張国 日本国 (JP)

(71) 出願人 000106324
サンスター株式会社
大阪府高槻市朝日町3番1号
(72) 発明者 清水 康光
大阪府高槻市西町29-21
(72) 発明者 原本 秀一
大阪市淀川区西三国2丁目2-16
(72) 発明者 中村 友美
大阪府茨木市舟木町4-7-203
(72) 発明者 松浦 昌宏
大阪府高槻市赤大路町41-1-312
(72) 発明者 苗代 英一
大阪府大東市南櫛の里町6-15

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】口腔用組成物

(57) 【要約】

【課題】口中に入れただけで唾液により、速やかに分散し、歯ブラシ等による清掃をすることができ、更に粘結剤と発泡剤(起泡剤)を適当な比添加することで口腔内の使用感が優れたものとなる新規な錠剤型の口腔用組成物を提供する。

【解決手段】研磨剤、発泡剤(起泡剤)、粘結剤及び潤滑剤に糖アルコール及び崩壊剤を特定比で組み合わせて配合する。

【選択図】 なし

【特許請求の範囲】**【請求項1】**

糖または糖アルコール、崩壊剤、研磨剤、発泡剤、粘結剤及び温潤剤を含有する錠剤であって、研磨剤、発泡剤、粘結剤及び温潤剤の合計配合量とそれ以外の成分の分量比が1：0.5～1：20の範囲であることを特徴とする速崩壊型の口腔用組成物。

【請求項2】

糖または糖アルコール、崩壊剤、研磨剤、発泡剤、粘結剤及び温潤剤を含有する錠剤であって、研磨剤、発泡剤、粘結剤及び温潤剤の合計配合量とそれ以外の成分の分量比が1：0.5～1：10の範囲であることを特徴とする速崩壊型の口腔用組成物。

【請求項3】

糖または糖アルコールが乳糖、エリスリトール、キシリトール、マンニトール、トレハロース、ソルビトール、マルチトール、イソマルチトール、パラチノース、パラチニット、ラクチトールから選択される1種以上である請求項1あるいは2項の何れかに記載の口腔用組成物。

【請求項4】

崩壊剤が架橋ポリビニルピロリドン、結晶セルロース、セルロースとその誘導体、デンプンとその誘導体から選択される少なくとも1種以上である請求項1、2及び3のいずれか1項に記載の口腔用組成物。

【請求項5】

研磨剤が磷酸水素カルシウム、炭酸カルシウム、水酸化アルミニウム、無水ケイ酸、ケイ酸塩、ハイドロキシアパタイト、ポリメタアクリレート、メタリン酸ナトリウム、ピロリン酸カルシウムから選択される少なくとも1種以上である請求項1、23及び4のいずれか1項に記載の口腔用組成物。

【請求項6】

発泡剤がラウリル硫酸ナトリウム、ミリスチル硫酸ナトリウム、ショ糖脂肪酸エステル、ラウロイルサルコシネート、ラウリルスルホカク酸塩から選択される少なくとも1種以上である請求項1、2、3、4及び5の何れか1項に記載の口腔用組成物。

【請求項7】

さらに塩化セチルピリジニウム、グルコン酸クロルヘキシジン、トリクロサン、イソプロピルメチルフェノール、グリチルリチンジカリウム、フッ化ナトリウム、モノフルオロ磷酸ナトリウム、カゼインホスホペプチド、クロロフィル、ハーブ、茶抽出物、乳酸アルミニウム、硝酸カリウム、乳酸菌、アズレンスルホン酸ナトリウム、アラントイン、コレステロール、塩化ナトリウム、塩化デカリニウム、アスコルビン酸、トコフェロール、ピロリン酸ナトリウム、ポリリン酸ナトリウム、ポリエチレングリコール(平均分子量200～20000)、ポリビニルピロリドン、塩化リゾチーム、ヒノキチオール、ラウロイルサルコシンナトリウム、ラクトフェリンから選択される1種以上を配合する請求項1、2、3、4、5及び6の何れか1項に記載の口腔用組成物。

【発明の詳細な説明】**【0001】****【発明が属する技術分野】**

本発明は固形剤型の口腔用組成物に関する。更に本発明は口腔内の健康の維持等に関する。

【0002】**【従来の技術】**

口腔内の健康を維持するため、歯を磨く際に現在ではペースト、液剤、ジェルなどの剤形が開発され、販売されている。これらの剤形は時代とともに変化してきたもので、古くは粉歯磨きや潤製歯磨きと呼ばれる粉体形状のものが中心であった。これらは使い勝手や衛生面の問題もあり、一部タバコ用途のものを除きほとんど用いられなくなるとともに、これまで固形剤型の検討はほとんど実施されてこなかったのが現状である。

【0003】

固形型口腔用組成物は例えば、特開昭61-236718号公報、特表平2-504030号公報、特表平4-500368号公報、特開平9-87154号公報及び英國特許第1259342号に開示されている。前記、特開昭61-236718号公報では携帯用としてのものが開示されている。使用方法は錠剤のもので噛み碎いて唾液と混合する必要があり、口中で速やかに分散するものではない。特表平2-504030号公報では口中で噛み碎く必要があり、使用上の問題があった。特表平4-500368号公報では粉末ソルビトールを多く含んでいるために錠剤の硬度が上昇し、口腔内の崩壊性、分散性については悪いという問題があった。また、英國特許第1259342号においては研磨剤、洗浄剤、粘結剤、界面活性剤及び油分吸着成分によって構成される錠剤型歯磨き剤が開示されているが、崩壊性の面において十分とは言えない点が問題点として残っていた。

【0004】

【特許文献1】

特開昭61-236718号公報

【特許文献2】

特表平02-504030号公報

【特許文献3】

特表平04-500368号公報

【特許文献4】

特開平09-087154号公報

【特許文献5】

英國特許第1259342号公報

【0005】

【発明が解決しようとする課題】

従って本発明の目的は、錠剤の崩壊に際して二酸化炭素等の発泡機構を用いることなく、口中に入れた後に、速やかに分散し、歯ブラシ等による清掃をすることでき、更に粘結剤と発泡剤（起泡剤）を適当な量を添加することで口腔内の使用感が優れたものとなる新規な錠剤型の口腔用組成物を提供するものである。

【0006】

【課題を解決するための手段】

本発明者らは上記課題を解決すべく鋭意検討した結果、歯みがきのために必要な研磨剤、発泡剤（起泡剤）、粘結剤及び湿潤剤に糖アルコール及び崩壊剤を特定比で組み合わせることにより、口腔内に錠剤を入れたときに使用感に優れる速崩壊性を有した錠剤型の組成物を得ることを見出し、本発明を完成させたものである。

【0007】

【発明の実施の形態】

本発明の固形型の口腔用組成物は歯磨成分である研磨剤、発泡剤（起泡剤）、粘結剤及び湿潤剤に糖アルコール及び崩壊剤を適量添加することにより、口腔内において優れた分散性を有しあつ使用感の良い固形剤を提供するものである。速崩壊型口腔用組成物とは、口中に含んだとき60秒以内に崩壊するものを指す。崩壊に要する時間は60秒以内、好ましくは45秒以内、より好ましくは30秒以内、更に好ましくは20秒以内である。

【0008】

本発明における歯磨成分の研磨剤、発泡剤（起泡剤）、粘結剤及び湿潤剤の合計量とそれ以外の成分の合計量が重量比で1:0.5~1:20、好ましくは1:0.5~1:10、最も好ましくは1:1~1:3の範囲である。歯磨成分の研磨剤、発泡剤（起泡剤）、粘結剤及び湿潤剤以外の成分の合計量が0.5より下回った場合、錠剤を形成するための成分が少なすぎるため打錠障害を発生したり、一部研磨剤を用いた場合、硬度が上昇し、崩壊性に問題が生じるようになる。また、歯磨成分の研磨剤、発泡剤（起泡剤）、粘結剤及び湿潤剤以外の成分が5より上回った場合、成形性は増すが、歯磨のための成分を十分量配合することが出来ず、歯磨剤としての目的を達成することが困難となる。

【0009】

本発明に用いる糖及び糖アルコールは糖または糖アルコールは特に限定されるものではないが乳糖、エリスリトール、キシリトール、マンニトール、トレハロース、ソルビトール、マルチトール、イソマルチトール、パラチノース、パラチニット、ラクチトールが好ましく、これらから少なくとも1種以上が選択され配合できる。

【 0 0 1 0 】

上記各成分の配合量は、添加される糖または糖アルコールにより成形性や口腔内における崩壊性を損なわない範囲であれば特に限定されるものではなく、本発明の口腔用組成物全量に対して10～70重量%が好ましく、より好ましくは30～60重量%である。10重量%に満たないと成形性が損なわれ、70重量%を超えると、硬度保持の観点から好ましくない。

【 0 0 1 1 】

本発明に用いる崩壊剤は特に限定されるものでなく、架橋ポリビニルピロリドン、結晶セルロース、セルロースとその誘導体、デンプンとその誘導体が好ましく、これらから少なくとも1種が選択される。これらの配合量は本発明の組成物全量に対して1～40重量%が好ましく、より好ましくは3～20重量%である。配合量が1重量%に満たないと成形性が損なわれ、40重量%を超えると成形性が損なわれる。

【 0 0 1 2 】

本発明に用いる研磨剤は通常歯磨に用いるものであれば特に限定するものではなく、燐酸水素カルシウム、炭酸カルシウム、水酸化アルミニウム、無水ケイ酸、ケイ酸塩、ハイドロキシアパタイト、ポリメタクリレート、メタリン酸ナトリウム、ピロリン酸カルシウムなどが好ましく、これらから少なくとも1種以上が選択される。この研磨剤成分の配合量は組成物全量に対して5～40重量%が好ましく、より好ましくは10～30重量%、最も好ましくは15～25重量%である。配合量が5重量%に満たないと口腔内清掃効果が充分発揮できず、また40重量%を超えて配合しても清掃効果はそれ以上向上しない。

【 0 0 1 3 】

本発明に用いる発泡剤は、通常、歯磨に用いられるアニオン性界面活性剤、ノニオン性界面活性剤であればよく、中でもアニオン性界面活性剤が好ましく、特にラウリル硫酸ナトリウム、ミリスチル硫酸ナトリウム、ショ糖脂肪酸エステル、ラウロイルサルコシネート、アルキルスルホコハク酸塩から少なくとも1種以上配合できる。この発泡剤の配合量は0.05～30重量%が好ましく、より好ましくは0.5～5重量%である。配合量が0.05重量%に満たないと起泡性が不足し、30重量%を超えて配合すると味が損なわれるので好ましくない。

【 0 0 1 4 】

さらに、本発明では塩化セチルピリジニウム、グルコン酸クロルヘキシジン、トリクロサン、イソプロピルメチルフェノール、グリチルリチンジカリウム、フッ化ナトリウム、モノフルオロ燐酸ナトリウム、カゼインホスホペプチド、クロロフィル、ハーブ、お茶抽出物、乳酸アルミニウム、硝酸カリウム、乳酸菌、アズレンスルホン酸ナトリウム、アラントイン、コレステロール、塩化ナトリウム、塩化デカリニウム、アスコルビン酸、トコフェロール、ピロリン酸ナトリウム、ポリリン酸ナトリウム、ポリエチレングリコール200～20000、ポリビニルピロリドン、塩化リゾチーム、ヒノキチオール、ラウロイルサルコシンナトリウムなどの薬効剤から少なくとも1種が選択され、その配合量はその有効性が発現される量であれば特に限定されるものではない。

【 0 0 1 5 】

本発明では、上記の成分以外に、キサンタンガム、アラビアガム、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、アルギン酸ナトリウム、グーガム、カラギーナン、ポリビニルアルコール、ポリアクリル酸ナトリウムなどの粘結剤が配合でき、その配合量は1錠あたり0.1mg～50mgが好ましく、より好ましくは3～20mgである。

【 0 0 1 6 】

また、グリセリン、ソルビトール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、エ

チレングリコールなどの潤滑剤が配合でき、その配合量は1錠あたり0.1mg～100mgが好ましい。そして香味剤、保存料、着色剤、pH調整剤等を本発明の目的を損なわない範囲において添加することができる。

【0017】

また、打錠時の障害を防止するために滑沢剤を添加することができ、その方法も内部滑沢法及び外部滑沢法の何れでも使用することができる。香味剤については嗜好的側面を充足させるために、歯磨き中及び歯磨後の爽快感、清涼感等を付与するために添加するものである。具体的にはサッカリンナトリウム、デキストロース、アスパルテーム、ステビアエキス、アセスルファーム、ペパーミント油、スペアミント油、オイゲノール、アネトール、スパイスなど安全性を有し、生理学的に許容されうるものであればいかなるものでも配合することが可能であり、固形型口腔用組成物にバリエーションを付与することが可能である。保存料はパラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸ブチル、パラオキシ安息香酸エチル、安息香酸ナトリウムなど安全性が確認されているものであれば配合することが可能である。着色剤は法定色素を中心に着色効果のあるものであれば配合することが可能である。pH調整剤はクエン酸及びその塩、リン酸およびその塩、リンゴ酸及びその塩、グルコン酸及びその塩、マレイン酸及びその塩、コハク酸及びその塩、グルクロン酸及びその塩、フマル酸及びその塩、アジピン酸及びその塩、乳酸及びその塩、塩酸、水酸化アルカリ金属等があげられる。

【0018】

本発明の口腔用組成物は錠剤型歯磨、錠菓、サプリメントとして提供でき、常法により製造できる。

【0019】

【実施例】

以下、実施例、比較例及び試験例により本発明を更に詳しく説明するが、本発明はこれらの実施例等により何ら限定されるものではない。

【0020】

表1に示す、実施例1～3及び比較例1～4を調製し、評価した。

代表的な製造法を示す。先ず、リン酸カルシウム、ラウリル硫酸ナトリウム、キサンタンガムなどを予めよく混合し、エリスリトールの20%水溶液を流動層造粒機にて噴霧し、十分に乾燥させる。その後、エリスリトールとトレハロースを加えよく混合した後、適量の水を噴霧・乾燥し造粒を行う。最後に、結晶セルロース、ステアリン酸マグネシウムを加え混合した後、1錠あたり500mgを打錠する。

【0021】

次に評価方法を示す。

崩壊時間：日本薬局方、第14局記載の崩壊試験法に準じて実施した。試験器を受軸に取り付け、ビーカーに入れ1分間30往復、振幅55mmにて上下運動させ試験を行った。

試験液は水を用い、温度は37℃とした。

◎：45秒以内、○：60秒以内、×：60秒を超える崩壊時間

崩壊時間（口腔内）：

◎：45秒以内、○：60秒以内、×：60秒を超える崩壊時間

唾液の量：

○：唾液が口の中からあふれない、×：唾液が口の中からあふれそうな感覚がある

泡立ち：調製品を口に含み、崩壊させた後にブラッシングを行い、泡立ちの程度を評価した。

○：実使用上問題ない泡立ちが得られる、×：泡立ちが十分でない或は泡立たない

総合評価：

A：崩壊時間（口腔内）が◎であり、×を含まない

B：各評価項目が○であり、×を含まない

C：×を含む

【0022】

【表1】

成分		実施例1	実施例2	実施例3	比較例1	比較例2	比較例3	比較例4
研磨剤	リン酸カルシウム	100	115		100			
	炭酸カルシウム			80		150		
	シリカ					120	200	
発泡剤	ラウリル硫酸Na	5	10		10	10		10
	ショ糖脂肪酸エステル			15				
接着剤	キサンタンガム	10			5		5	5
	アルギン酸ナトリウム		10					
	カルボキシメチルセルロース			10				
潤滑剤	グリセリン	10		5	10	10	10	10
	ソルビトール液		15					残部
乳糖/糖アルコール	エリスリトール	残部	残部	残部	残部	残部	残部	
	トレハロース	50			50	50	50	
	乳糖	100						
	マンニトール			25				
崩壊剤	クロスカルメロースナトリウム	50		40		50	50	
	クロスボビドン		30					
賦形剤	結晶セルロース	75		60		75	75	50
薬効剤	CPC	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25
滑潤剤	ステアリン酸Mg	10	12	4	10	10	10	10
防腐剤	パラベン	5	6		5	5	5	5
香味剤	香料	5	6	4	5	5	5	5
合計(単位 mg)		500	600	400	500	500	500	500
評価	崩壊時間	○	○	◎	×	○	○	×
	崩壊時間(口腔内)	○	○	◎	×	○	○	×
	唾液の量	○	○	○	○	×	○	○
	泡立ち	○	○	○	○	×	×	×
	総合評価	B	B	A	C	C	C	C

【0023】

表1からも明らかなように、本発明の実施例は比較例に比べ、崩壊性、使用感に優れていた。

【0024】

実施例4

速崩壊型歯磨

成分	配合量 (mg)
無水ケイ酸	200
ラウリル硫酸ナトリウム	10
キサンタンガム	5
グリセリン	10
エリスリトール	残部
トレハロース	50
結晶セルロース	50
塩化セチルピリジニウム	0.25
ステアリン酸マグネシウム	10
パラベン	5
合計	500

【0025】

実施例5

速崩壊型歯磨

成分	配合量 (mg)
リン酸カルシウム	115
ラウリル硫酸ナトリウム	10
アルギン酸ナトリウム	10
ソルビトール液	15
エリスリトール	残部

乳糖	100
クロスポピドン	30
モノフルオロリン酸ナトリウム	3
ステアリン酸マグネシウム	12
パラベン	5
合計	600

実施例 1 に準ずる方法にて製造、600mgに打錠した。

【0026】

実施例 6

速崩壊型歯磨

成分	配合量 (mg)
炭酸カルシウム	80
ラウリルスルホコハク酸ナトリウム	100
カルボキシメチルセルロースナトリウム	10
グリセリン	5
マンニトール	残部
クロスカルメロースナトリウム	30
硝酸カリウム	20
ショ糖脂肪酸ラウリルエステル	4
ステアリン酸マグネシウム	12
パラベン	4
合計	400

実施例 1 に準ずる方法にて製造、400mgに打錠した。

【0027】

実施例 7

速崩壊型歯磨

成分	配合量 (mg)
乳酸菌配合リン酸カルシウム	115
(乳酸菌: <i>Lactobacillus salivarius</i> を 107 cells 吸着したもの)	
アルギン酸ナトリウム	10
ソルビトール液	15
エリスリトール	残部
トレハロース	100
クロスポピドン	30
ステアリン酸マグネシウム	12
合計	600

【0028】

実施例 4～7 を実施例 1 と同様の方法にて調製し、1錠あたり 600mg にて、1t の負荷にて打錠した。の打錠品を用いて日本薬局方に規定された崩壊試験とパネラー (10名) による口腔内での崩壊時間の測定を実施した結果、すべて 60 秒以内に口腔内で崩壊し、中でも実施例 6 は 45 秒以内に崩壊した。

【0029】

【発明の効果】

本発明によれば、歯磨成分である研磨剤、発泡剤(起泡剤)、粘結剤及び潤滑剤に糖アルコール及び崩壊剤を適量添加することにより、口腔内において優れた分散性を有しつつ使用感の良い固形型の口腔用組成物が提供できる。

F ターム(参考) 4C083 AA111 AB031 AB081 AB082 AB101 AB171 AB172 AB281 AB282 AB311
AB322 AB371 AC122 AC131 AC132 AC242 AC301 AC471 AC482 AC781
AC782 AC791 AC792 AC811 AC851 AC852 AD041 AD071 AD072 AD091
AD201 AD202 AD211 AD212 AD241 AD261 AD262 AD272 AD302 AD352
AD411 AD471 AD491 AD531 AD551 AD641 AD661 BB55 CC41 DD15
EE07

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2004-026816

(43)Date of publication of application : 29.01.2004

(51)Int.Cl.

A61K 7/16

(21)Application number : 2003-128936

(71)Applicant : SUNSTAR INC

(22)Date of filing : 07.05.2003

(72)Inventor : SHIMIZU YASUMITSU
KISHIMOTO SHUICHI
NAKAMURA TOMOMI
MATSUURA MASAHIRO
NAESHIRO HIDEKAZU

(30)Priority

Priority number : 2002132323 Priority date : 08.05.2002 Priority country : JP

(54) COMPOSITION FOR ORAL CAVITY

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new tablet type composition for applying to the oral cavity, quickly dispersed with saliva when the composition is put in mouth, cleaned by using a teeth brush, or the like, and imparted with excellent feeling in use in the oral cavity by adding a binding agent and a foaming (whipping) agent in a proper ratio.

SOLUTION: A sugar alcohol and a disintegrating agent are added to an abrasive, the foaming (whipping) agent, the binding agent and a humectant by combining them in a specific ratio.

*** NOTICES ***

JPO and INPIT are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
2. **** shows the word which can not be translated.
3. In the drawings, any words are not translated.

CLAIMS

[Claim(s)]

[Claim 1]

A fast-disintegrable constituent for the mouths, wherein it is a tablet containing sugar or sugar-alcohol, disintegrator, abrasive soap, a foaming agent, a binder, and a wetting agent and a range of a daily dose ratio of sum total loadings of abrasive soap, a foaming agent, a binder, and a wetting agent and the other ingredient is 1:0.5-1:20.

[Claim 2]

A fast-disintegrable constituent for the mouths, wherein it is a tablet containing sugar or sugar-alcohol, disintegrator, abrasive soap, a foaming agent, a binder, and a wetting agent and a range of a daily dose ratio of sum total loadings of abrasive soap, a foaming agent, a binder, and a wetting agent and the other ingredient is 1:0.5-1:10.

[Claim 3]

Sugar or sugar-alcohol Milk sugar, erythritol, xylitol, mannitol, A constituent for the mouths given in any of Claim 1 or the 2nd clause which are one or more sorts chosen from trehalose, sorbitol, maltitol, isomaltitol, a paratinose, palatinit, and a RAKUCHI toll they are.

[Claim 4]

Claim 1 which is at least one or more sorts as which disintegrator is chosen from a bridge construction polyvinyl pyrrolidone, crystalline cellulose, cellulose, the derivative and starch, and its derivative, a constituent for the mouths given in any 1 clause of 2 and 3.

[Claim 5]

Abrasive soap Calcium hydrogen phosphate, calcium carbonate, aluminium hydroxide, Claim 1 which is at least one or more sorts chosen from a silicic acid anhydride, a silicate, hydroxyapatite, poly methacrylate, sodium metaphosphate, and calcium pyrophosphate, a constituent for the mouths given in any 1 clause of 23 and 4.

[Claim 6]

Claims 1, 2, 3 and 4 which are at least one or more sorts as which a foaming agent is chosen from sodium lauryl sulfate, myristyl sodium sulfate, sucrose fatty acid ester, lauroyl sarcosinate, and lauryl sulfosuccinate, and a constituent for the mouths given in any 1 clause of 5.

[Claim 7]

Furthermore, cetylpyridinium chloride, chlorhexidine glyconate, triclosan, Isopropylmethyl phenol, glicyrrhizin JIKARIUMU, sodium fluoride, Monofluorosodium phosphate, casein phosphopeptide, chlorophyll, A herb, a tea extract, aluminum lactate, potassium nitrate, lactic acid bacteria, azulene sulfonate sodium, Allantoin, cholesterol, sodium chloride, dequalinium chloride, Ascorbic acid, tocopherol, sodium pyrophosphate, sodium polyphosphate, A polyethylene glycol (average molecular weights 200-20000), a polyvinyl pyrrolidone, Lysozyme chloride, hinokitiol, lauroyl sarcosine sodium, Claims 1, 2, 3 and 4 that blend one or more sorts chosen from lactoferrin, a constituent for the mouths given in any 1 clause of 5 and 6.

[Translation done.]

*** NOTICES ***

JPO and INPIT are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
2. *** shows the word which can not be translated.
3. In the drawings, any words are not translated.

DETAILED DESCRIPTION**[Detailed Description of the Invention]****[0001]****[The technical field to which invention belongs]**

This invention relates to the solid preparation type constituent for the mouths. This invention relates to maintenance of the health in the mouth, etc.

[0002]**[Description of the Prior Art]**

In order to maintain the health in the mouth, when brushing one's teeth, dosage forms, such as a paste, liquids and solutions, and gell, are developed and sold now. The thing of the powder object form which these dosage forms have changed with the time and is called powder toothbrushing and toothbrushing made from ** in ancient times was a center. While these will also have a problem of user-friendliness or a sanitary aspect and a part will hardly be used except for the thing of a tobacco use, the actual condition is that most solid preparation type examination was not carried out until now.

[0003]

The constituent for the solid type mouths is indicated by JP,S61-236718,A, JP,H2-504030,A, JP,H4-500368,A, JP,H9-87154,A, and U.K. Pat. No. 1259342. The thing as portable is indicated in the above and JP,S61-236718,A. It is necessary to be a thing of a tablet, to crunch and to mix with saliva, and directions for use are not promptly distributed by inner mouth. In JP,H2-504030,A, it needed to crunch in the mouth and there was a problem of use. In JP,H4-500368,A, since many powder sorbitol was included, the hardness of the tablet rose, and there was a problem that it was bad, about the collapsibility within the mouth, and dispersibility. Although the tablet type tooth paste constituted by abrasive soap, a detergent, a binder, a surface-active agent, and the oil adsorbing component in U.K. Pat. No. 1259342 was indicated, the point which cannot be referred to as enough in the field of collapsibility remained as a problem.

[0004]**[Patent documents 1]**

JP,S61-236718,A

[Patent documents 2]

JP,H02-504030,A

[Patent documents 3]

JP,H04-500368,A

[Patent documents 4]

JP,H09-087154,A

[Patent documents 5]

U.K. Pat. No. 1259342 gazette

[0005]**[Problem to be solved by the invention]**

Therefore, the purpose of this invention, without using foaming mechanisms, such as carbon dioxide, on the occasion of collapse of a tablet, After putting into inner mouth, it can distribute promptly, and cleaning by a toothbrush etc. can be carried out, and also the new tablet type

constituent for the mouths which becomes that the using feeling within the mouth excelled [that] in adding a suitable quantity about a binder and a foaming agent (frothing agent) is provided.

[0006]

[Means for solving problem]

As a result of inquiring wholeheartedly that an aforementioned problem should be solved, this invention persons by combining sugar-alcohol and disintegrator with abrasive soap required for dentifrice, a foaming agent (frothing agent), a binder, and a wetting agent by a specific ratio, When a tablet is put in in the mouth, it finds out obtaining a tablet type constituent with the fast disintegrability which is excellent in a using feeling, and this invention is completed.

[0007]

[Mode for carrying out the invention]

By adding a proper quantity of sugar-alcohol and disintegrator to the abrasive soap, the foaming agent (frothing agent), binder, and wetting agent which are toothbrushing ingredients, the solid type constituent for the mouths of this invention has the dispersibility outstanding in the mouth, and provides the good solid preparation of a using feeling. The constituent for the fast-disintegrable mouths refers to what collapses within 60 seconds, when contained in a mouth. The time which collapse takes is less than 20 seconds still more preferably less than 30 seconds more preferably less than 45 seconds less than 60 seconds.

[0008]

the total quantity of abrasive soap of a toothbrushing ingredient in this invention, a foaming agent (frothing agent), a binder, and a wetting agent, and the total quantity of the other ingredient -- a weight ratio -- 1:0.5-1:20 -- desirable -- 1:0.5-1:10 -- it is the range of 1:1-1:3 most preferably. When a tabletting obstacle is generated since there are too few ingredients for forming a tablet when the total quantity of ingredients other than abrasive soap of a toothbrushing ingredient, a foaming agent (frothing agent), a binder, and a wetting agent is less from 0.5, or abrasive soap is used in part, hardness rises and a problem comes to arise in collapsibility. When ingredients other than abrasive soap of a toothbrushing ingredient, a foaming agent (frothing agent), a binder, and a wetting agent exceed from 5, a moldability increases, but quantity combination of the ingredient for toothbrushing cannot be carried out enough, but it becomes difficult to attain the purpose as dentifrices.

[0009]

Although sugar and sugar-alcohol which are used for this invention are not limited, sugar or especially sugar-alcohol Milk sugar, Erythritol, xylitol, mannitol, trehalose, sorbitol, maltitol, isomaltitol, a paratinose, palatinit, and a RAKUCHI toll are preferred, at least one or more sorts are chosen from these, and it can blend.

[0010]

Especially if loadings of each above-mentioned ingredient are a range which spoils neither a moldability nor collapsibility in the mouth with sugar or sugar-alcohol added, they are not limited, its 10 to 70 weight % is preferred to the constituent whole quantity for the mouths of this invention, and they are 30 to 60 weight % more preferably. If a moldability will be spoiled if it does not fill to 10weight %, and it exceeds 70 weight %, it is not desirable from a viewpoint of hardness maintenance.

[0011]

The disintegrator in particular used for this invention is not limited, a bridge construction polyvinyl pyrrolidone, crystalline cellulose, cellulose, the derivative and starch, and its derivative are preferred, and at least one sort is chosen from these. As for these loadings, 1 to 40 weight % is preferred to the constituent whole quantity of this invention, and they are 3 to 20 weight % more preferably. If loadings are not filled to 1weight %, a moldability will be spoiled, and a moldability will be spoiled if it exceeds 40 weight %.

[0012]

It is not what will be limited especially if the abrasive soap used for this invention is usually used for toothbrushing, Calcium hydrogen phosphate, calcium carbonate, aluminium hydroxide, a silicic acid anhydride, a silicate, hydroxyapatite, poly methacrylate, sodium metaphosphate, calcium

pyrophosphate, etc. are preferred, and at least one or more sorts can be blended from these. As for the loadings of this abrasive soap ingredient, 5 to 40 weight % is preferred to the constituent whole quantity, and they are 15 to 25 weight % most preferably ten to 30 weight %. If loadings are not filled to 5 weight %, even if the cleaning effect in the mouth cannot demonstrate enough and will blend exceeding 40 weight %, a cleaning effect does not improve any more.

[0013]

The anionic surface-active agent with which the foaming agent used for this invention is usually used for toothbrushing, What is necessary is just a nonionic surface-active agent, and an anionic surface-active agent is preferred and can blend at least one or more sorts especially from sodium lauryl sulfate, myristyl sodium sulfate, sucrose fatty acid ester, lauroyl sarcosinate, and alkyl sulfosuccinate. As for the loadings of this foaming agent, 0.05 to 30 weight % is preferred, and they are 0.5 to 5 weight % more preferably. Since the taste will be impaired if foamability runs short if loadings are not filled to 0.05 weight %, and it blends exceeding 30 weight %, it is not desirable.

[0014]

In this invention, cetylpyridinium chloride, chlorhexidine glyconate, Triclosan, isopropylmethyl phenol, glycyrhizin JIKARIUMU, Sodium fluoride, monofluorosodium phosphate, casein phosphopeptide, Chlorophyll, a herb, a tea extract, aluminum lactate, potassium nitrate, Lactic acid bacteria, azulene sulfonate sodium, allantoin, cholesterol, Sodium chloride, dequalinium chloride, ascorbic acid, tocopherol, Sodium pyrophosphate, sodium polyphosphate, the polyethylene glycols 200-20000, a polyvinyl pyrrolidone, At least one sort is chosen from drug effect agents, such as lysozyme chloride, hinokitiol, and lauroyl sarcosine sodium, and especially if the loadings are a quantity by which the validity is revealed, they will not be limited.

[0015]

In this invention, in addition to the above-mentioned ingredient, xanthan gum, gum arabic, methyl cellulose, Being able to blend binders, such as carboxymethylcellulose sodium, sodium alginate, a guar gum, a carrageenan, polyvinyl alcohol, and sodium polyacrylate, as for the loadings, 0.1 mg - 50 mg per dose are preferred, and they are 3-20 mg more preferably.

[0016]

Wetting agents, such as glycerin, sorbitol, propylene glycol, a polyethylene glycol, and ethylene glycol, can be blended, and, as for the loadings, 0.1 mg - 100 mg per dose are preferred. And a flavor agent, preservatives, colorant, a pH adjuster, etc. can be added in the range which does not spoil the purpose of this invention.

[0017]

In order to prevent the obstacle at the time of tabletting, lubricant can be added, and the method can also use either an internal lubricating method or an external lubricating method. It adds in order to make the taste side satisfy about a flavor agent, and to give the invigoration under toothbrushing and after toothbrushing, coolness, etc. Specifically Saccharin sodium, glucose, Aspartame, A stevia extract, an ASESURU farm, peppermint oil, spearmint oil, If it has safeties, such as eugenol, anethole, and a spice, it approves physiologically and it gets, it is possible to blend anythings, and it is possible to give a variation to the constituent for the solid type mouths. Preservatives can be blended if safeties, such as methyl parahydroxybenzoate, butyl parahydroxybenzoate, ethyl p-hydroxybenzoate, and sodium benzoate, are confirmed. Colorant can be blended if there is a coloring effect centering on a certified color. PH regulator Citrate and its salt, phosphoric acid and its salt, malic acid, and its salt, Gluconic acid and its salt, maleic acid and its salt, succinic acid and its salt, glucuronic acid and its salt, fumaric acid and its salt, adipic acid and its salt, lactic acid and its salt, chloride, a hydroxylation alkaline metal, etc. are raised.

[0018]

The constituent for the mouths of this invention can be provided as tablet type toothbrushing, a hard candy, and a supplement, and can be manufactured with a conventional method.

[0019]

[Working example]

Hereafter, although an working example, a comparative example, and the example of an

examination explain this invention in more detail, this invention is not limited at all by these working examples.

[0020]

The working examples 1-3 and the comparative examples 1-4 which are shown in Table 1 were prepared and evaluated.

A typical manufacturing method is shown. First, calcium phosphate, sodium lauryl sulfate, xanthan gum, etc. are mixed well beforehand, and the 20% solution of erythritol is sprayed in a fluidized bed granulator, and is fully dried. Then, after being easy to add erythritol and trehalose and mixing, optimum dose of water is sprayed and dried and granulation is performed. Finally, after adding crystalline cellulose and magnesium stearate and mixing, 500 mg per dose is tableted.

[0021]

Next, a valuation method is shown.

Decay time: It carried out according to the disintegration test of the Pharmacopoeia of Japan and the 14th-game description. It examined by attaching a tester to a receive shaft, putting into a beaker, and making it move up and down with 30 during 1 minute round trip, and the amplitude of 55 mm. Test liquid was 37 ** in temperature using water.

O : less than 45 seconds, less than [O:60 second], decay time exceeding x:60 second

Decay time (inside of the mouth) :

O : less than 45 seconds, less than [O:60 second], decay time exceeding x:60 second

Quantity of saliva :

O : there is feeling in which saliva does not have overflow out of a mouth and which x:saliva is likely to be full of out of a mouth.

Foaming: It brushed, after including the preparation in the mouth and collapsing it, and the grade of foaming was evaluated.

O x from which satisfactory foaming is obtained on :actual use : or foaming is not enough, don't foam.

Overall evaluation :

A: Decay time (inside of the mouth) is O, and does not contain x.

B: Each evaluation criteria are O and do not contain x.

C: x is included.

[0022]

[Table 1]

成分		実施例1	実施例2	実施例3	比較例1	比較例2	比較例3	比較例4
研磨剤	リン酸カルシウム	100	115		100			
	炭酸カルシウム			80		150		
	シリカ						120	200
発泡剤	ラウリル硫酸Na	5	10		10	10		10
	ショ糖脂肪酸エster			15				
粘着剤	キサンタンガム	10			5		5	5
	アルギン酸ナトリウム		10					
	カルボキシメチルセルロース			10				
潤滑剤	グリセリン	10		5	10	10	10	
	ソルビトール液			15				残部
乳糖/ 糖アルコール	エリスリトール	残部	残部	残部	残部	残部	残部	
	トレハロース	50			50	50	50	
	乳糖		100					
崩壊剤	クロスカルメースナトリウム	50		40		50	50	
	クロスボビドン		30					
賦形剤	結晶セルロース	75		60		75	75	50
	CPC	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25	0.25
清潔剤	ステアリン酸Mg	10	12	4	10	10	10	10
	防腐剤	パラベン	5	6		5	5	5
香味剤	香料	5	6	4	5	5	5	5
	合計(単位 mg)	500	600	400	500	500	500	500
評価	崩壊時間	○	○	◎	×	○	○	×
	崩壊時間(口腔内)	○	○	◎	×	○	○	×
	唾液の量	○	○	○	○	×	○	○
	泡立ち	○	○	○	○	×	×	×
	総合評価	B	B	A	C	C	C	C

[0023]

The working example of this invention was excellent in collapsibility and a using feeling compared with the comparative example so that clearly also from Table 1.

[0024]

Working example 4

Fast-disintegrable toothbrushing

Ingredient Loadings (mg)

Silicic acid anhydride 200

Sodium lauryl sulfate 10

Xanthan gum 5

Glycerin 10

Erythritol Remainder

Trehalose 50

Crystalline cellulose 50

Cetylpyridinium chloride 0.25

Magnesium stearate 10

Paraben 5

Sum total 500

[0025]

Working example 5

Fast-disintegrable toothbrushing

Ingredient Loadings (mg)

Calcium phosphate 115

Sodium lauryl sulfate 10

Sodium alginate 10

Sorbitol liquid 15

Erythritol Remainder

Milk sugar 100

Crossing POPIDON 30

Sodium monofluorophosphate 3

Magnesium stearate 12

Paraben 5

Sum total 600

It tableted to manufacture and 600 mg by the method according to the working example 1.

[0026]

Working example 6

Fast-disintegrable toothbrushing

Ingredient Loadings (mg)

Calcium carbonate 80

Lauryl sulfo sodium succinate 100

Carboxymethylcellulose sodium 10

Glycerin 5

Mannitol Remainder

Crossing carmellose sodium 30

Potassium nitrate 20

Sucrose fatty acid lauryl ester 4

Magnesium stearate 12

Paraben 4

Sum total 400

It tableted to manufacture and 400 mg by the method according to the working example 1.

[0027]

Working example 7

Fast-disintegrable toothbrushing

Ingredient Loadings (mg)

Lactic-acid-bacteria combination calcium phosphate 115

(Lactic acid bacteria: What carried out 107cell adsorption of Lactobacillus salivarius)

Sodium alginate 10

Sorbitol liquid 15

Erythritol Remainder

Trehalose 100

Crossing POPIDON 30

Magnesium stearate 12

Sum total 600

[0028]

The working examples 4-7 were prepared by the same method as the working example 1, and it tableted by the load of 1 t at 600 mg per dose. As a result of measuring the decay time within the mouth by the disintegration test and panelist (ten persons) who were specified to the Pharmacopoeia of Japan using ******, it collapsed within the mouth within 60 seconds altogether, and the working example 6 collapsed within 45 seconds especially.

[0029]

[Effect of the Invention]

In this invention, a proper quantity of sugar-alcohol and disintegrator are added to the abrasive soap, the foaming agent (frothing agent), binder, and wetting agent which are toothbrushing ingredients.

Therefore, it has the dispersibility outstanding in the mouth, and the good solid type constituent for the mouths of a using feeling can be provided.

[Translation done.]